

# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT


### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

REC'D 16 JAN 2006

WIPO

PCT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055173	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/014210	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 14.12.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 17.12.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D487/04, A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt 4 Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Bescheids</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags  17.10.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  13.01.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter  Zellner, A  Tel. +49 89 2399-8078	



**Feld Nr. I Grundlage des Berichts**

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
- ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
  - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
  - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile**\* der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*:

**Beschreibung, Seiten**

1-25 in der ursprünglich eingereichten Fassung.

**Ansprüche, Nr.**

1-13 eingegangen am 18.10.2005 mit Schreiben vom 12.10.2005

- ☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll
3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung: Seite
  - ☐ Ansprüche: Nr.
  - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
  - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
  - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
- ☐ Beschreibung: Seite
  - ☐ Ansprüche: Nr.
  - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
  - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
  - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

\* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/014210

---

## Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

---

1. Feststellung
- |                                |                            |
|--------------------------------|----------------------------|
| Neuheit (N)                    | Ja: Ansprüche 2-4,6-10,12  |
|                                | Nein: Ansprüche 1,5,11,13  |
| Erfinderische Tätigkeit (IS)   | Ja: Ansprüche 7            |
|                                | Nein: Ansprüche 2-4,6,8-13 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche 1-13         |
|                                | Nein: Ansprüche:           |

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

**siehe Beiblatt**

---

## Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen

---

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)

und / oder

2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)

**siehe Beiblatt**

---

## Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung

---

Es wurde festgestellt, daß die internationale Anmeldung nach Form oder Inhalt folgende Mängel aufweist:

**siehe Beiblatt**

1. In diesem Bescheid werden folgende, im Recherchenbericht zitierte Dokumente (D) genannt; die Numerierung wird auch im weiteren Verfahren beibehalten:  
  
D1: US-A-5 994 360 (PFRENGLE ET AL) 30. November 1999 (1999-11-30)  
D2: WO 02/38565 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; DITRICH, KLAUS; SAUTER) 16. Mai 2002 (2002-05-16)  
D3: EP-A-0 834 513 (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 8. April 1998 (1998-04-08)  
D4: US-A-5 965 561 (PEES ET AL) 12. Oktober 1999 (1999-10-12)  
D5: EP-A-0 071 792 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 16. Februar 1983 (1983-02-16)  
D6: WO 02/083677 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 24. Oktober 2002 (2002-10-24)  
D7: WO 03/093271 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 13. November 2003 (2003-11-13)  
D8: WO 2004/087705 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 14. Oktober 2004 (2004-10-14)  
D9: WO 2004/087706 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 14. Oktober 2004 (2004-10-14)  
D10: WO 2004/058765 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; MUELLER, BERND; TORMO I BLASCO, JORDI; GROTE,) 15. Juli 2004 (2004-07-15)  
  
2. Die vorliegende Anmeldung bezieht sich auf Triazolopyrimidine und deren Verwendung im Pflanzenschutz.  
  
3. Die mit Schreiben vom 12.10.2005 eingereichten Änderungen erfüllen die Erfordernisse des Art. 34(2)(b) PCT.

zu Punkt V

4. Neuheit (Art. 33(2) PCT)  
  
4.1. Dokument D1 offenbart Verbindungen der allg. Formel (I), deren Definition teilweise mit

der Definition der Verbindungen der vorliegenden Ansprüche 1 und 5 überlappt (D1, Spalte 2-4:  $R^3$  = alkyl group (Spalte 3: 1-6, preferably 1-3 C-atoms);  $R^4$  = hydrogen;  $(L)_n$  = pentafluoro;  $A = N$ ;  $R^2$  = hydrogen;  $R$  = cycloalkyl (Spalte 3: 3 carbon atoms, preferably 5 carbon atoms) or 2,2,2-trifluoroethyl (Spalte 5, Z. 19)). D1 offenbart zudem Mittel umfassend die besagten Verbindungen und deren Verwendung zur Bekämpfung von pathogenen Schadpilzen (Spalten 7, letzter Absatz, Spalte 11, Absatz 3). Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche 1, 5 sowie 11 und 13 wird somit neuheitsschädlich offenbart.

4.2. Die im Dokument D2 offenbaren Verbindungen können keinen Substituenten  $R^1$  gemäss geändertem Anspruch 1 aufweisen. D2 ist somit nicht als neuheitsschädlich gegenüber der vorliegenden Anmeldung anzusehen.

5. Erfinderische Tätigkeit (Art. 33(3) PCT)

5.1. Der Gegenstand des vorliegenden Anspruchs 2 wird als neu gegenüber dem zitierten Stand der Technik erachtet. Ausgehend von D3 bzw. D4 als nächstliegendem Stand der Technik unterscheiden sich die darin beanspruchten Verbindungen durch die Natur des Substituenten X (D3, D4: Beispiele 2, 4, 8, 10, 15-17, 19, 21 und 23-26). Gemäss vorliegendem Anspruch 2 kann der besagte Substituent aus fünf verschiedenen Klassen von Substituenten ausgewählt werden, die sich zunächst durch kein gemeinsames Merkmal von den Verbindungen aus D3 bzw. D4 unterscheiden. Zunächst wird jedoch kein Einwand wegen mangelnder Einheitlichkeit erhoben. Aus den vorliegenden Anmeldeunterlagen scheint nicht hervorzugehen, dass die im Anspruch 2 für X angegebenen Substituenten zu gegenüber den Verbindungen aus D3/D4 verbesserten Eigenschaften der Verbindungen I führen. Das zu lösende technische Problem wird deshalb in der Bereitstellung alternativer Verbindungen zur Bekämpfung pflanzenpathogener Schadpilze gesehen. Ausgehend von einem der Dokumente D3 oder D4 als nächstliegendem Stand der Technik scheint es zunächst naheliegend für den Fachmann, sich auch der technischen Lehre der Dokumente D2, D6 oder D7 zu bedienen, die sich mit strukturell eng verwandten Verbindungen für denselben Zweck befassen, und auf der Suche nach alternativen Verbindungen zumindest solche bereitzustellen, die über Substituenten verfügen, welche auf demselben Gebiet bei strukturell sehr eng verwandten Verbindungen bekannt sind. Hierzu zählen gemäss D2,

D6 oder D7 auch Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Haloalkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy. Deren Verwendung scheint deshalb zunächst zur Lösung der technischen Aufgabe nahegelegt zu sein.

- 5.2. Aus denselben Gründen wird auch der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche 3, 4, 6 und 8 sowie 9-13 nicht als erfinderisch erachtet.
- 5.3. Die mit Schreiben vom 12.10.2005 vorgelegten Vergleichsversuche werden zwar als überzeugend hinsichtlich des Vorliegens einer erfinderischen Tätigkeit der beanspruchten Verbindungen, worin X = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet, angesehen, jedoch sind diese Verbindungen nicht neu gegenüber D1 (siehe oben).

6. Industrielle Anwendbarkeit (Art. 33(4) PCT)

Wird anerkannt für die Ansprüche 1-13.

zu Punkt VI

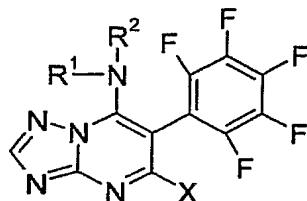
7. Die Dokumente D8-D10 wurden nach dem Prioritätsdatum der vorliegenden Anmeldung, aber vor dem Datum dessen internationalen Anmeldung veröffentlicht. Bei ungültiger Priorität der vorliegenden Anmeldung würde daher deren Inhalt als zum Stand der Technik gehörig betrachtet werden. Selbst bei gültiger Priorität werden die Dokumente D8 und D9 im regionalen europäischen Verfahren zur Beurteilung von Neuheit herangezogen.

zu Punkt VII

8. Im Widerspruch zu den Erfordernissen der Regel 5.1(a)(ii) PCT werden in der Beschreibung weder der in den Dokumenten 1, 3, 4, 5 und 7 offenbarte einschlägige Stand der Technik noch diese Dokumente angegeben.

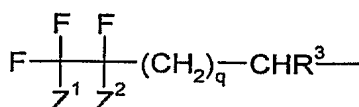
## Patentansprüche

## 1. 6-Pentafluorphenyl-triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R<sup>1</sup> C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, welches durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann, oder eine Gruppe A:



A

10 worin

Z<sup>1</sup> Wasserstoff, Fluor oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Fluoroalkyl,

Z<sup>2</sup> Wasserstoff oder Fluor, oder

Z<sup>1</sup> und Z<sup>2</sup> bilden gemeinsam eine Doppelbindung;

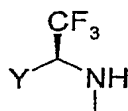
15 q 0 oder 1 ist; und

R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl bedeuten;

R<sup>2</sup> Wasserstoff, Methyl oder Ethyl;

20 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycliyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann;

25 oder R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, eine Gruppe



30

bilden, wobei Y für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht;

27

X Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyloxy.

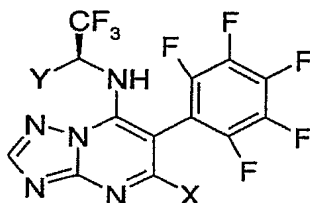
2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyloxy bedeutet.
3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X Cyano bedeutet.
4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X Methoxy bedeutet.
5. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet.
6. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> folgende Bedeutung haben:

R<sup>1</sup> CH(CH<sub>3</sub>)-CF<sub>3</sub>, Cyclopentyl, Cyclohexyl;

R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl; oder

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> bilden gemeinsam -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CF<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-.

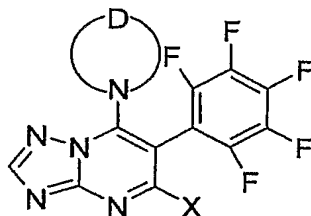
7. Verbindungen der Formel I.2.



I.2

in der Y für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und X für Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy steht.

8. Verbindungen der Formel I.3,



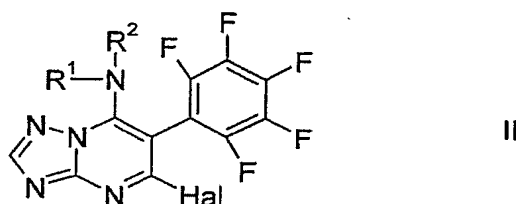
I.3

in der



- D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann; und
- X Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 2, durch Umsetzung von 5-Halogen-6-(pentafluorphenyl)-triazolopyrimidinen der Formel II

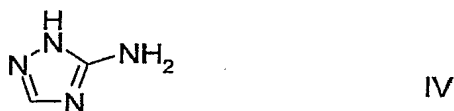


in der Hal für ein Halogenatom steht, mit Verbindungen der Formel III

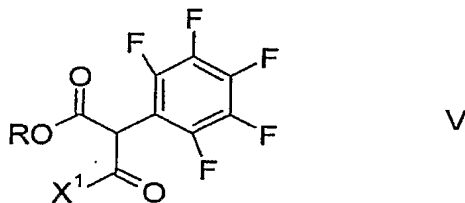


in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetall-Kation steht und X die Bedeutung gemäß Anspruch 2 hat.

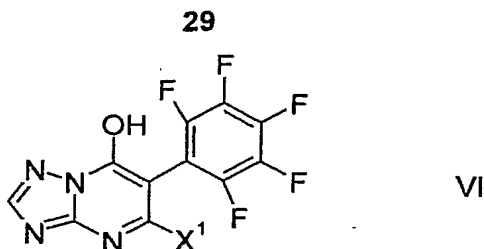
10. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 5, durch Umsetzung von 2-Aminotriazol der Formel IV



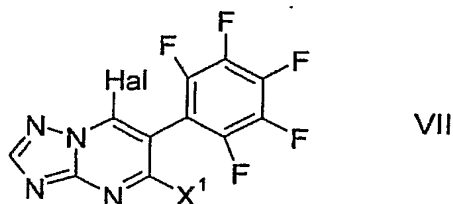
mit Ketoestern der Formel V,



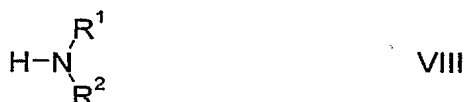
in der R und X<sup>1</sup> unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeuten und L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup> und L<sup>3</sup> gemäß Anspruch 1 definiert sind, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidinen der Formel VI,



Halogenierung von VI mit Halogenierungsmitteln zu Halogenpyrimidinen der Formel VII,



- 5 in der Hal für ein Halogenatom steht, und Umsetzung von VII mit Aminen der Formel VIII,



in der R¹ und R² die Bedeutung wie in Formel I haben.

- 10 11. Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2.
12. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2 in einer Menge von 1 bis 1000 g/100 kg
- 15 13. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2 behandelt.